

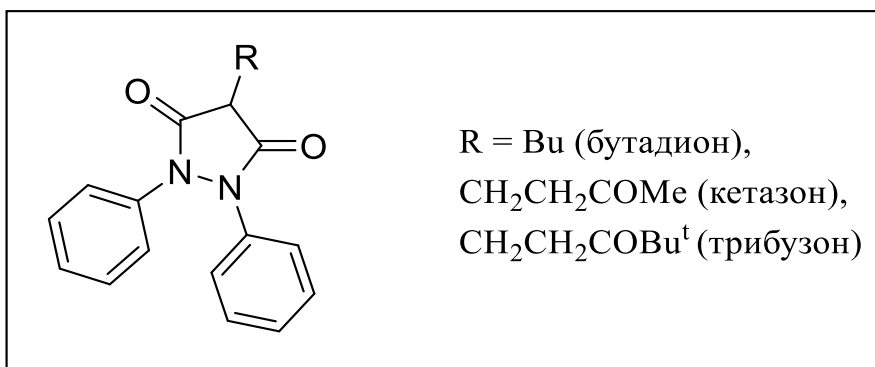
О. Г. Худина, Я. В. Бургарт,
В. И. Салоутин

Институт органического синтеза
им. И. Я. Постовского УрО РАН,
620137, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22,
kog@ios.uran.ru

ФУНКЦИОНАЛИЗАЦИЯ 1,2-ДИФЕНИЛПИРАЗОЛИДИН-3,5-ДИОНА*

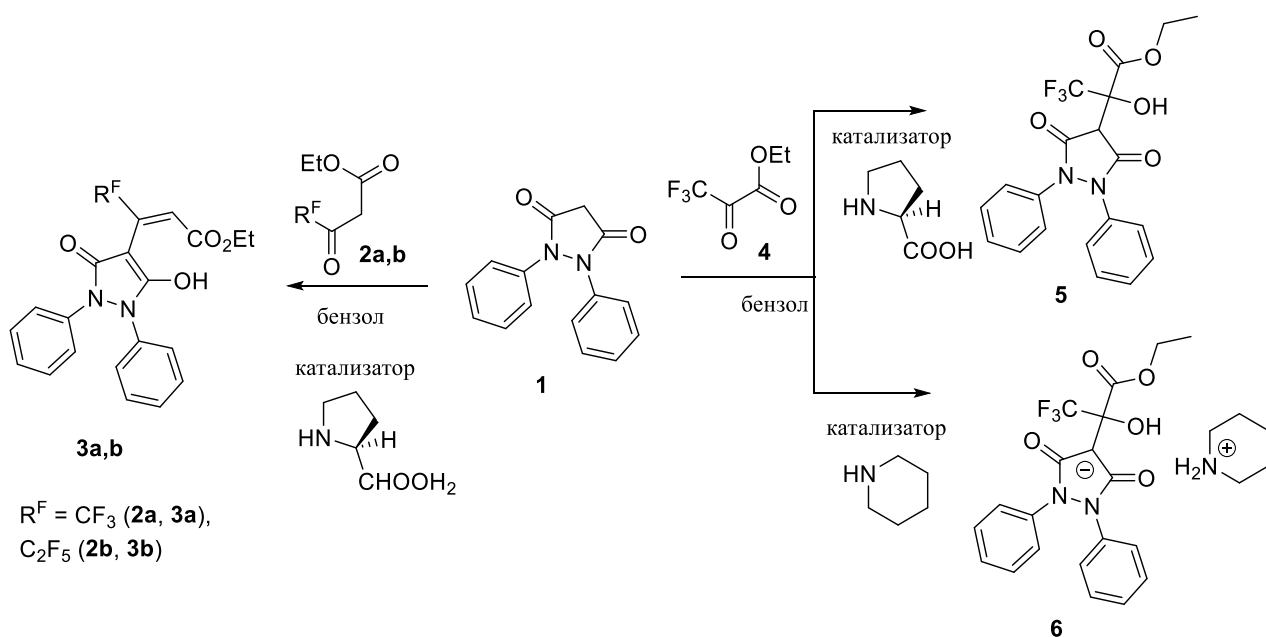
Ключевые слова: реакция Кнёвенагеля, полифторалкил-2- и 3-оксоэфиры, 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-дион.

Известный нестероидный противовоспалительный препарат *бутадион* (фенилбутазон) и его структурные аналоги (*кетазон*, *трибузон*), модифицированные по положению 4 пиразолидинового цикла, оказывают анальгетическое, жаропонижающее и противовоспалительное действия. Их назначают при ревматоидном артрите, анкилозирующем спондилите, артрозе, при воспалительных заболеваниях кровеносных сосудов и при подагре [1, 2].



Однако *бутадион* и его аналоги имеют многочисленные противопоказания [1, 2], что обуславливает целесообразность поиска производных 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-диона с минимальными побочными эффектами.

Нами были получены полифторалкилсодержащие структурные аналоги *кетазона* и *трибузона*. Найдено, что 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-дион **1** вступает в конденсацию Кнёвенагеля с полифторалкилзамещенными 3-оксоэфирами **2a,b** в присутствии катализатора *L*-пролина с образованием этил (2*E*)-3-(3,5-диоксо-1,2-дифенилпиразолидин-4-ил)-3-полифторалкилпроп-2-еноатов **3a,b**.



Реакция Кнёвенагеля 1,2-дифенилпиразолидин-3,5-диона **1** с этил 3,3,3-трифтор-2-оксoproпаноатом **4** в присутствии основания (*L*-пролин, пиперидин) останавливается на стадии присоединения эфира **4** по активированному метиленовому фрагменту пиразолидинона **1** без отщепления молекулы воды с образованием аддуктов **5**, **6**. При использовании эквимольного количества пиперидина в качестве основания конечным продуктом реакции является соль **6** пиперидина с этил 2-(3,5-диоксо-1,2-дифенилпиразолидин-4-ил)-3,3,3-трифтор-2-гидрокси-пропаноатом **5**.

Список литературы

1. Машковский М. Д. Лекарственные средства. М.: Новая волна, 2012. 1216 с.
2. Лекарственные средства: свойства, применение, противопоказания: справочник / под ред. М. А. Клюева. М.: Русская книга, 1993. 576 с.

* Работа выполнена в рамках государственного задания АААА-А19-119011790130-3.